



(19) 日本国特許庁

公開特許公報

特許願 (2)

昭和47年6月22日

特許庁長官 井土武久 殿

1. 発明の名称

ベンズイミダゾール誘導体の製造法

2. 発明者

カクシン本アマメタフアムラ
住所 大分県中津市大字島田字前堂
氏名 ハセガワ グン
長谷川 元 (はか 1名)

3. 特許出願人

大阪市東区平野町8丁目35番地
名称 (872) 吉富製薬株式会社
代表者 不破泰

4. 代理人

大阪市東区平野町8丁目35番地
吉富製薬株式会社内

氏名 代理士(6630)高宮城勝

5. 添付書類の目録

- (1) 明細書 1通
- (2) 委任状 1通
- (3) 特許権副本 1通

47-063027

(11) 特開昭 49-20174

(43) 公開日 昭49.(1974)2.22

(21) 特願昭 47-63027

(22) 出願日 昭47.(1972)6.22

審査請求 未請求 (全4頁)

序内整理番号

(52) 日本分類

6855 44

16 E363

6224 44

30 B4

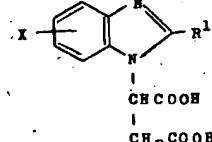
明細書

1. 発明の名称

ベンズイミダゾール誘導体の製造法

2. 特許請求の範囲

一般式



[式中のXは水素、ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ基を、R¹は水素、低級アルキル、ヒドロキシ低級アルキル、ハロ低級アル

キルを示す。]

で表わされる化合物と一般式

R²-NH₂

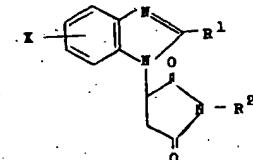
[式中のR²は水素、低級アルキル、低級アル

キシ低級アルキル、シクロアルキル、核に置換基

を有していてもよいアリール、アルキルを示す。]

で表わされるアミン類とを反応させることを特徴

とする一般式



[式中のX、R¹、R²は前記のものと同様であ

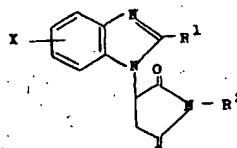
る。]

で表わされるベンズイミダゾール誘導体またはそ

の塩の製造法。

3. 発明の詳細な説明

本発明は一般式



(I)

BEST AVAILABLE COPY

〔式中の X は水素、ハロゲン(F 、 Cl 、 Br 等)。

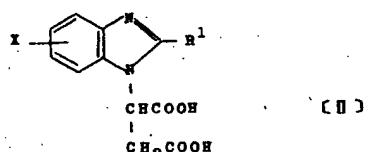
低級アルキル(メチル、エチル、プロピル、ブチル等)、低級アルコキシ(メトキシ、エトキシ等)、ニトロ基を、 R^1 は水素、低級アルキル、ヒドロキシ低級アルキル(ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル等)、ハロ低級アルキル(クロメチル、2-クロルエチル等)を、 R^2 は水素、低級アルキル、低級アルコキシ低級アルキル(2-メトキシエチル、3-メトキシプロピル等)、シクロアルキル(シクロヘキシル、シクロヘキシル、3,3,5-トリメチルシクロヘキシル、シクロドデシル等)、シクロアルキル低級アルキル(シクロヘキシルメチル等)、核に置換基{ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ基、ポリハロ低級アルキル(トリフルオロメチル等)、低級アルコキシカルボニル(メトキカルボニル、

特開昭49-20174 (2)

エトキカルボニル等)、低級アルキルチオ(メチルチオ、エチルチオ等)}を有し、または有しないアリール(フェニル、ナフチル等)、アラカル(ベンジル、フェネチル等)を示す。〕

で表わされるベンズイミダゾール誘導体の製造法に関するものである。

本発明によれば一般式〔I〕で表わされる化合物は一般式



〔式中の R^1 は前記のものと同義である。〕

で表わされる化合物と一般式



〔式中の R^2 は前記のものと同義である。〕

を兼ねさせることもできる。

一般式〔I〕で表わされる化合物は所望により酸化槽、硫酸槽、シウク酸槽、マレイン酸槽、ビクリン酸槽等の無機あるいは有機酸槽にすることもできる。

かくして得られる本発明の化合物は中枢抑制作用、血圧低下作用を有し、医薬として有用である。

以下に実施例を示して本発明をさらに具体的に説明する。

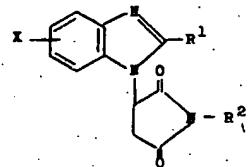
実施例 1

2-(1-ベンズイミダゾリル)コハク酸・1水和物5.0 gを塩化アセチル5.0 gに加え、8時間還流する。反応液を完全浸浴し、冰冷下に2倍当量のアンモニアを含むエタノール溶液を加えた後、エタノールを留去する。残留物にポリリン酸3.0 gを加え、1:1.0~1:2.0で2時間操作す

ル-1-ベンズイミダゾリル)スクシンイミド

2.0 g が無色結晶として得られる。

同様にして以下の化合物が製造できる。



実施例	X	R ¹	R ²	熔・融点 (°C)
3	H	H	ブチル	熔融塩 190~192.5
4	H	H	(CH ₂) ₃ OCH ₃	熔融塩・1/2水和物 153~156
5	H	H	シクロヘキシル	シユクヘキシル 192~194
6	H	H	3,3,5-トリメチルシグローバン	160~162
7	H	H	フェニル	186~188
8	H	H	p-クロルフェニル	シユクヘキシル・1/2水和物 189~188.5
9	H	H	p-クロルフェニル	ヘインジン 145~147
10	H	H	o-トリル	シユクヘキシル 193~195
11	H	H	p-エトキシフェニル	188~190

BEST AVAILABLE COPY

実施例	X	R ¹	R ²	熔・融点 (°C)
12	H	H	p-エトキシカルボニルフェニル	181~183.5
13	H	H	p-トリフルオロメチルフェニル	シユクヘキシル 173~174
14	H	H	p-ニトロフェニル	100~203
15	H	H	1-ナフチル	シユクヘキシル 185~186
16	H	H	ヘンゼン	熔融塩 201.5~204.5
17	H	メチル	ブチル	シユクヘキシル 138~143
18	H	メチル	2,6-キシリル	197~201
19	H	エチル	p-エトキシフェニル	193~194.5
20	H	-CH ₂ OH	p-クロルフェニル	198~200
21	H	-CH ₂ OH	p-エトキシフェニル	シユクヘキシル・1/2水和物 170~171.5
22	5 or (6)-Cl	H	2,5-ジクロルフェニル	197~198
23	H	-CH ₂ Cl	p-エトキシフェニル	
24	H	H	p-メチルオキシフェニル	
25	5 or (6)-NO ₂	H	p-エトキシフェニル	
26	5 or (6)-OCF ₃	H	p-エトキシフェニル	
27	5 or (6)-CH ₃	H	p-エトキシフェニル	
28	H	H	シクロヘキシル/ブチル	

代理人 弁理士 高宮敏一

手 続 换 正 書 (方式)

昭和47年10月5日

特許庁長官三宅幸夫殿

1. 事件の表示

昭和47年特許願第63021号

2. 発明の名称

ベンズイミダゾール誘導体の製造法

3. 换正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 大阪市東区平野町3丁目35番地

名称 吉富製薬株式会社

(672) 代表者 不破泰

4. 代理人

電話連絡先:吉富製薬株式会社(本部上中)TEL270-3551

住所 大阪市東区平野町3丁目35番地

吉富製薬株式会社内

氏名 弁理士高宮城勝



5. 换正の対象

願書の発明者の欄

(2,000円)

特 許 願 (3)

昭和47年6月22日

特許庁長官井土武久殿

1. 発明の名称

ベンズイミダゾール誘導体の製造法

2. 発明者

住所 大分県中津市大字島田字清堂455-3

氏名 ハセガワグン

(ほか1名)

3. 特許出願人

住所 大阪市東区平野町3丁目35番地

名称 吉富製薬株式会社

(672) 代表者 不破泰

4. 代理人

住所 大阪市東区平野町3丁目35番地

吉富製薬株式会社内

氏名 弁理士(6630)高宮城勝

5. 添付書類の目録

(1) 明細書 1通

(2) 委任状 1通

(3) 特許願副本 1通

6. 换正命令の日付(発送日)

昭和47年9月26日

7. 换正の内容

願書の発明者の欄の住所「大分県中津市大字

シタツアマドウナカツシオアマベタツア
島田字清堂」を「大分県中津市大字島田字キヨドウ
清堂455-3」とする。

8. 添付書類

特許願 正副各1通

以上

BEST AVAILABLE COPY